

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. Oktober 2001 (18.10.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/77084 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 239/54, 403/12, 401/12, 239/34, A01N 43/54

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/03332

(22) Internationales Anmeldedatum:
23. März 2001 (23.03.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 16 893.0 5. April 2000 (05.04.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ANDREE, Roland [DE/DE]; Dechant-Miebach-Weg 37, 40764 Langenfeld (DE). SCHWARZ, Hans-Georg [DE/DE]; Heinenbusch 19e, 40764 Langenfeld (DE). LINKER, Karl-Heinz [DE/DE]; Kurt-Schumacher-Ring 56, 51377 Leverkusen (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestr. 38, 40764 Langenfeld (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrückerstr. 61, 41470 Neuss (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, 40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am Kloster 69, 42799 Leichlingen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

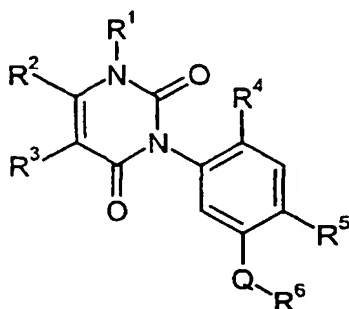
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED PHENYLURACILS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PHENYLURACILE



(I)

(57) Abstract: Phenyluracils of general formula (I) wherein Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ have the meaning cited in the description. The invention also relates to methods for the production and use thereof as herbicides.

(57) Zusammenfassung: Phenyluracile der allgemeinen Formel (I) in welcher Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ eine in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben, sowie Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

WO 01/77084 A1

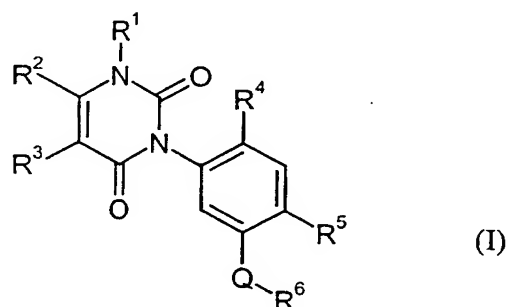
BEST AVAILABLE COPY

Substituierte Phenyluracile

Die Erfindung betrifft neue substituierte Phenyluracile, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel, insbesondere als Herbizide.

Es ist bekannt, dass bestimmte substituierte Phenyluracile herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP 408382/US 5084084/US 5127935/US5154755, EP 563384, EP 648749, US 4979982, US 5169430, WO 91/00278, WO-A-97/01541, WO-A-00/02866, WO-A-98/41093). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine nennenswerte Bedeutung erlangt.

Es wurden nun die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I)



in welcher

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO₂ steht,

R¹ für Wasserstoff, Amino, gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

- R^2 für Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- 5 R^3 für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- R^4 für Wasserstoff, Nitro, Cyano oder Halogen steht,
- 10 R^5 für Cyano, Thiocarbamoyl, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, und
- 15 R^6 für eine gegebenenfalls durch Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Cyano-C₁-C₄-alkyl, Carboxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonylalkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Cyano-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, Carboxy-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl-amino, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-amino oder C₁-C₄-Alkyl-sulfonyl-amino substituierte stickstoffhaltige heterocyclische Gruppierung aus der Reihe Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Triazoliny, Pyridiny, Pyraziny, Pyridaziny, Pyrimidiny, Triaziny, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Chinoliny, Chinazoliny, Chinoxaliny steht,
- 20
- 25

- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) -

5 gefunden.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkandiyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

10

Bevorzugte Substituenten bzw. bevorzugte Bereiche der oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im Folgenden definiert.

Q steht bevorzugt für O (Sauerstoff), S (Schwefel) oder SO₂.

15

R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl.

20

R² steht bevorzugt für Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl.

25

R³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

30

R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor oder Brom.

R⁵ steht bevorzugt für Cyano, Thiocarbamoyl, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.

5 R⁶ steht bevorzugt für eine jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Chlormethyl, Fluormethyl, Dichlormethyl, Di-
10 fluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Chlorethyl, Fluorethyl, Dichlorethyl, Difluorethyl, Chlorfluorethyl, Trichlorethyl, Trifluorethyl, Chlordifluorethyl, Fluordichlorethyl, Tetrafluorethyl, Chlortrifluorethyl, Pentafluorethyl, Chlor-n-propyl, Fluor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Fluor-i-propyl, Dichlorpropyl, Difluorpropyl, Tri-
15 chlorpropyl, Trifluorpropyl, Cyanomethyl, Cyanoethyl, Cyanopropyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, n- oder i-Propoxycarbonylmethyl, Methylaminocarbonylmethyl, Ethylaminocarbonylmethyl, Dimethylaminocarbonylmethyl, Methoxycarbonylethyl, Ethoxycarbonylethyl, n- oder i-Propoxycarbonyl-
20 ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Carboxymethoxy, Carboxyethoxy, Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylmethoxy, Methylaminocarbonylmethoxy, Ethylaminocarbonylmethoxy, Dimethylaminocarbonylmethoxy, Methoxycarbonylethoxy, Ethoxycarbonylethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylethoxy, Methylaminocarbonylethoxy, Ethylaminocarbonylethoxy, Dimethylaminocarbonylethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Pro-
25 pylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Pro-
30 pylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Propionylamino, n- oder i-

Butyroylamino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino substituierte stickstoffhaltige heterocyclische Gruppierung aus der Reihe Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Triazoliny, Pyridinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Chinolinyl, Chinazolinyl, Chinoxalinyl.

Q steht besonders bevorzugt für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel).

10 R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl.

15 R² steht besonders bevorzugt für Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl.

20 R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl.

R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor oder Chlor.

25 R⁵ steht besonders bevorzugt für Cyano, Thiocarbamoyl, Brom oder Trifluormethyl.

30 R⁶ steht besonders bevorzugt für eine jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Dichlormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Carboxymethoxy, Carboxyethoxy,

Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylmethoxy, Methoxycarbonylethoxy, Ethoxycarbonylethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Propionylamino, n- oder i-Butyroylamino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino substituierte stickstoffhaltige heterocyclische Gruppierung aus der Reihe Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Triazoliny, Pyridinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Chinolinyl, Chinazolinyl, Chinoxalinyl.

Q steht ganz besonders bevorzugt für O (Sauerstoff).

R¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Methyl oder Ethyl.

R² steht ganz besonders bevorzugt für Cyano oder Trifluormethyl.

R³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor oder Methyl.

R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Thiocarbamoyl oder Brom.

R⁶ steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Dichlormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Carboxymethoxy, Carboxyethoxy, Methoxycarbonylmethoxy,

5 Ethoxycarbonylmethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylmethoxy, Methoxycarbonylethoxy, Ethoxycarbonylethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Propionylamino, n- oder i-Butyroylamino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino substituiertes Pyrazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl oder Benzoxazolyl.

R¹ steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder Methyl.

15 R² steht am meisten bevorzugt für Trifluormethyl.

R⁵ steht am meisten bevorzugt für Cyano oder Brom.

20 R⁶ steht am meisten bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Amino, Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trichlormethyl, Methoxy oder Ethoxy, substituiertes Pyrazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl oder Benzoxazolyl.

R⁶ steht besonders hervorgehoben für Pyrimidinyl.

25 Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q für O (Sauerstoff) steht,

30 R¹ für Methyl steht,

R² für Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

5 R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Cyano steht und

10 R⁶ für 1-Methyl-pyrazol-5-yl, 1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl, 1,3,4-Trimethyl-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-s-Butyl-pyrazol-5-yl oder 1-t-Butyl-pyrazol-5-yl steht.

15

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

20 Q für O (Sauerstoff) steht,

R¹ für Methyl steht,

R² für Trifluormethyl steht,

25

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

30 R⁵ für Brom steht und

R⁶ für 1-Methyl-pyrazol-5-yl, 1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl, 1,3,4-Trimethyl-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-s-Butyl-pyrazol-5-yl oder 1-t-Butyl-pyrazol-5-yl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q für O (Sauerstoff) steht,

R¹ für Amino steht,

R² für Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Cyano steht und

R⁶ für 1-Methyl-pyrazol-5-yl, 1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl, 1,3,4-Trimethyl-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-s-Butyl-pyrazol-5-yl oder 1-t-Butyl-pyrazol-5-yl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q für O (Sauerstoff) steht,

R¹ für Amino steht,

R² für Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Brom steht und

R⁶ für 1-Methyl-pyrazol-5-yl, 1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl, 1,3,4-Trimethyl-pyrazol-5-yl, 1-Methyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-Ethyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-methyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Propyl-3-trifluormethyl-pyrazol-5-yl, 1-n-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-i-Butyl-pyrazol-5-yl, 1-s-Butyl-pyrazol-5-yl oder 1-t-Butyl-pyrazol-5-yl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die vorausgehend angegebenen Bedeutungen haben und

R⁶ für Pyrimidin-2-yl, 5-Chlor-pyrimidin-2-yl, 5-Fluor-pyrimidin-2-yl, 4,5-Dichlor-pyrimidin-2-yl, 4,5-Difluor-pyrimidin-2-yl, 4-Chlor-5-fluor-pyrimidin-2-yl, 4-Methyl-pyrimidin-2-yl, 4,6-Dimethyl-pyrimidin-2-yl, 4-Methyl-6-tri-

fluormethyl-pyrimidin-2-yl, 5-Chlor-4,6-dimethyl-pyrimidin-2-yl, 5-Fluor-4,6-dimethyl-pyrimidin-2-yl, 4,5,6-Trimethyl-pyrimidin-2-yl, 4-Methoxy-6-methyl-pyrimidin-2-yl, 6-Difluormethoxy-4-methyl-pyrimidin-2-yl, 4-Methoxy-6-trifluormethyl-pyrimidin-2-yl, 4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl, Pyrimidin-4-yl, 6-Chlor-pyrimidin-4-yl, 5,6-Dichlor-pyrimidin-4-yl, 6-Chlor-5-fluor-pyrimidin-4-yl, 6-Methyl-pyrimidin-4-yl, 5-Chlor-6-methyl-pyrimidin-4-yl, 6-Trifluormethyl-pyrimidin-4-yl, 6-Hydroxy-pyrimidin-4-yl, 6-Methoxy-pyrimidin-4-yl, 6-Methoxycarbonylmethoxy-pyrimidin-4-yl, 6-Ethoxycarbonylmethoxy-pyrimidin-4-yl, 6-Methoxycarbonylethoxy-pyrimidin-4-yl, 6-Ethoxycarbonylethoxy-pyrimidin-4-yl, 6-Chlor-5-fluor-pyrimidin-4-yl, 5-Fluor-4-hydroxy-pyrimidin-4-yl oder 5-Fluor-6-methoxy-pyrimidin-4-yl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die vorausgehend angegebenen Bedeutungen haben und

R⁶ für Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 3-Chlor-pyridin-2-yl, 3-Fluor-pyridin-2-yl, 4-Chlor-pyridin-2-yl, 4-Fluor-pyridin-2-yl, 5-Chlor-pyridin-2-yl, 5-Fluor-pyridin-2-yl, 3,4-Dichlor-pyridin-2-yl, 3,5-Dichlor-pyridin-2-yl, 3,6-Dichlor-pyridin-2-yl, 3,4-Difluor-pyridin-2-yl, 3,5-Difluor-pyridin-2-yl, 3,6-Difluor-pyridin-2-yl, 3,5,6-Trichlor-pyridin-2-yl, 3,5,6-Trifluor-pyridin-2-yl, 3-Cyano-pyridin-2-yl, 4-Cyano-pyridin-2-yl, 5-Cyano-pyridin-2-yl, 6-Cyano-pyridin-2-yl, 3-Methyl-pyridin-2-yl, 4-Methyl-pyridin-2-yl, 5-Methyl-pyridin-2-yl, 6-Methyl-pyridin-2-yl, 4-Chlor-pyridin-3-yl, 4-Fluor-pyridin-3-yl, 5-Chlor-pyridin-3-yl, 5-Fluor-pyridin-3-yl, 6-Chlor-pyridin-3-yl, 6-Fluor-pyridin-3-yl, 4,5-Dichlor-pyridin-3-yl, 4,5-Difluor-pyridin-3-yl, 2-Cyano-pyridin-3-yl, 4-Cyano-pyridin-3-yl, 5-Cyano-pyridin-3-yl, 6-Cyano-pyridin-3-yl, 2-Methyl-pyridin-3-yl, 4-Methyl-pyridin-3-yl, 5-Methyl-pyridin-3-yl, 6-Methyl-pyridin-3-yl, 2-Chlor-pyridin-4-yl, 2-Fluor-pyridin-4-yl, 3-Chlor-

pyridin-4-yl, 3-Fluor-pyridin-4-yl, 2-Cyano-pyridin-4-yl, 3-Cyano-pyridin-4-yl, 2-Methyl-pyridin-4-yl oder 3-Methyl-pyridin-4-yl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die vorausgehend angegebenen Bedeutungen haben und

R⁶ für Pyrimidin-2-yl, 5-Chlor-pyrimidin-2-yl, 5-Fluor-pyrimidin-2-yl, 4,5-Dichlor-pyrimidin-2-yl, 4,5-Difluor-pyrimidin-2-yl, 4-Chlor-5-fluor-pyrimidin-2-yl, 4-Methyl-pyrimidin-2-yl, 4,6-Dimethyl-pyrimidin-2-yl, 4-Methyl-6-trifluormethyl-pyrimidin-2-yl, 5-Chlor-4,6-dimethyl-pyrimidin-2-yl, 5-Fluor-4,6-dimethyl-pyrimidin-2-yl, 4,5,6-Trimethyl-pyrimidin-2-yl, 4-Methoxy-6-methyl-pyrimidin-2-yl, 6-Difluormethoxy-4-methyl-pyrimidin-2-yl, 4-Methoxy-6-trifluormethyl-pyrimidin-2-yl, 4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl steht.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind die diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

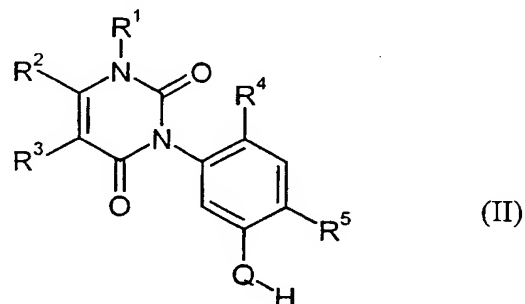
Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als am meisten bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese
5 Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I) weisen interessante biologische Eigenschaften auf. Sie zeichnen sich insbesondere durch starke
10 herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I), wenn man

15 (a) Phenyluracile der allgemeinen Formel (II)



in welcher

Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben,

20 mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

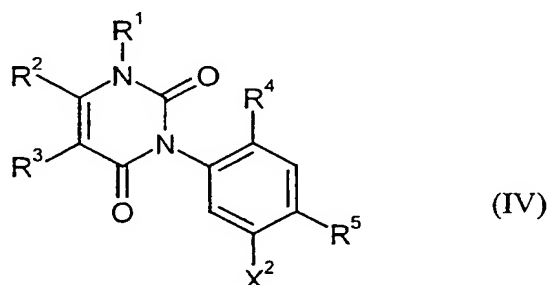
25 R⁶ die oben angegebene Bedeutung hat und

X^1 für Halogen oder Alkylsulfonyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in
5 Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

(b) Halogenphenyluracile der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die oben angegebene Bedeutung haben, und

X^2 für Halogen steht,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)



in welcher

Q und R^6 die oben angegebene Bedeutung haben und

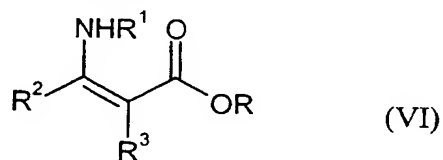
M für Wasserstoff oder ein Metalläquivalent steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

5

(c) Aminoalkensäureester der allgemeinen Formel (VI)



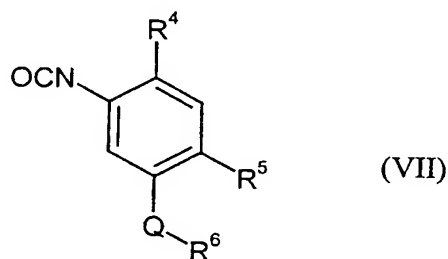
in welcher

10 R¹, R² und R³ die oben angegebene Bedeutung haben und

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

mit substituierten Phenylisocyanaten der allgemeinen Formel (VII)

15

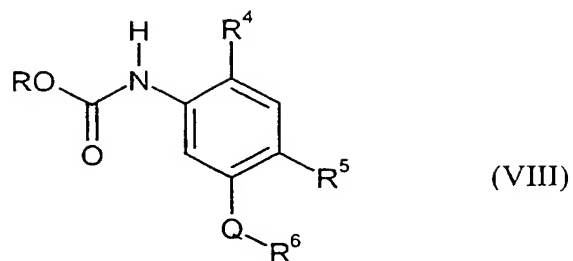


in welcher

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben,

20

oder mit substituierten Phenylurethanen (Phenylcarbamaten) der allgemeinen Formel (VIII)



in welcher

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben und

5

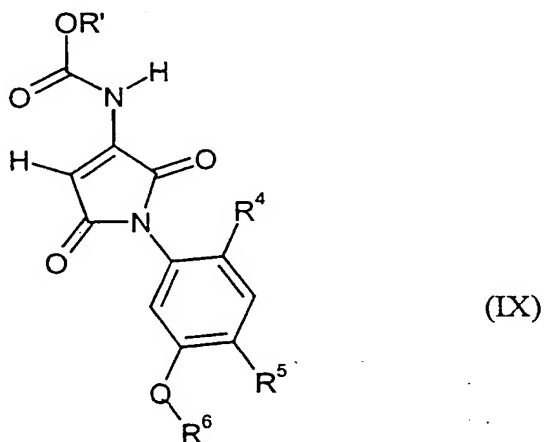
R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Verdünnungsmittel umgesetzt,

10

oder wenn man

(d) substituierte N-Phenyl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide der allgemeinen
Formel (IX)



15

in welcher

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben und

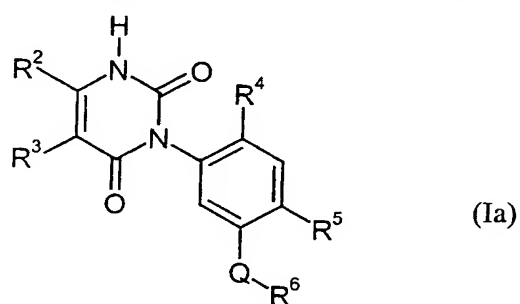
R' für Alkyl steht,

mit einem Metallhydroxid in Gegenwart von Wasser und gegebenenfalls in Gegenwart eines organischen Lösungsmittels umsetzt,

5

oder wenn man

(e) substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (Ia)



10 in welcher

Q, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben,

mit 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol oder 2-Aminooxysulfonyl-1,3,5-trimethylbenzol
bzw. mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (X)

15



in welcher

20

A¹ für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, und

25

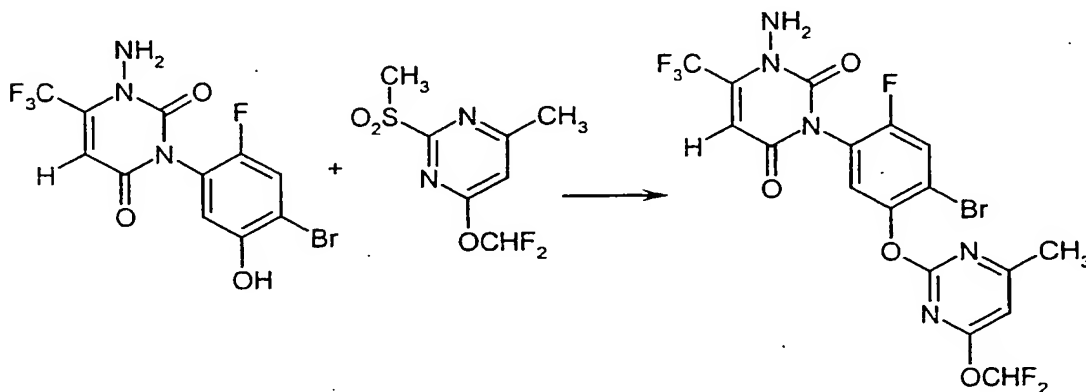
X³ für Halogen oder die Gruppierung -O-SO₂-O-A¹ steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittel umgesetzt,

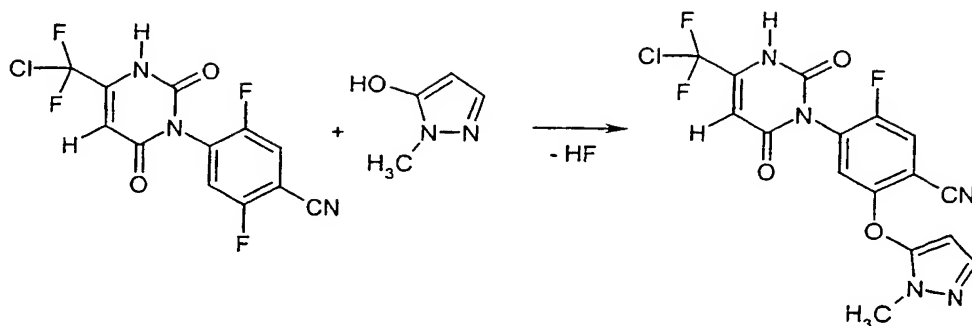
- 5 und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt.

10 Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise durch Umsetzung mit Dicyan bzw. Hydrogensulfid (z.B. $R^5: Br \rightarrow CN, CN \rightarrow CSNH_2$, vgl. die Herstellungsbeispiele).

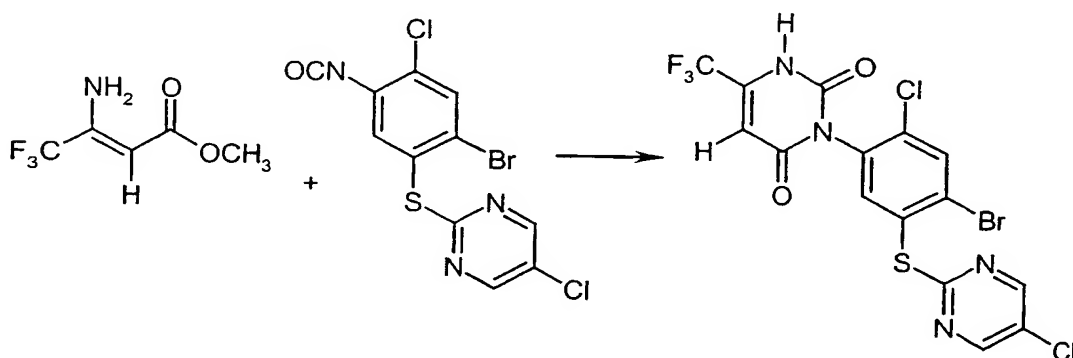
15 Verwendet man beispielsweise 3-Amino-1-(2-chlor-4-brom-5-hydroxy-phenyl)-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin und 4-Difluormethoxy-6-methyl-2-methylsulfonyl-pyrimidin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



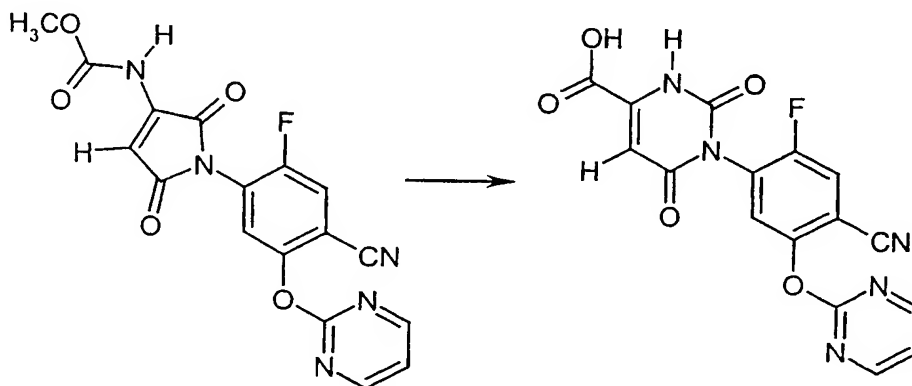
- 20 Verwendet man beispielsweise 1-(4-Cyano-2,5-difluor-phenyl)-4-chlordifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin und 5-Hydroxy-1-methyl-pyrazol als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



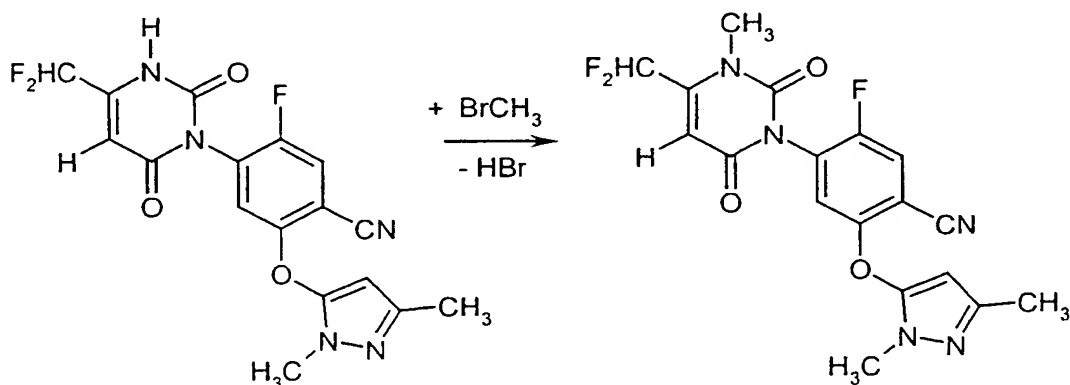
Verwendet man beispielsweise 3-Amino-4,4,4-trifluor-crotonsäure-methylester und 4-Brom-2-chlor-5-(5-chlor-pyrimidin-2-yl-thio)-phenylisocyanat als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise [1-[4-Cyano-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl)-phenyl]-2,5-dioxo-2,5-dihydro-1H-pyrrrol-3-yl]-carbamidsäure-methylester als Ausgangsstoff, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 1-[4-Cyano-2-fluor-5-(1,3-dimethyl-pyrazol-5-yl-oxy)-phenyl]-4-difluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin und Methylbromid als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (e) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Phenyluracile sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. WO-A-97/01541, WO-A-98/54155).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat R⁶ vorzugsweise diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt für R⁶ angegeben worden ist; X¹ steht vorzugsweise

für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder Alkylsulfonyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Fluor, Chlor, Brom oder Methylsulfonyl.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind weitgehend bekannte organische Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Halogenphenyluracile sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (IV) haben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt für R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 angegeben worden sind; X^2 steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A-648749).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (V) haben Q und R^6 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt für Q und R^6 angegeben worden sind; M steht vorzugsweise für Wasserstoff oder ein Alkalimetall, insbesondere für Wasserstoff, Natrium oder Kalium.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (V) sind weitgehend bekannte organische Syntheschemikalien.

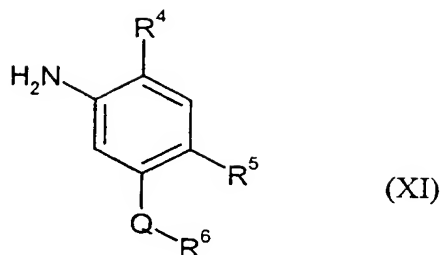
Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aminoalkensäureester sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (VI) haben R^1 , R^2 und R^3 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt für R^1 , R^2 und R^3 angegeben worden sind; R steht vorzugsweise für C_1 - C_4 -Alkyl, Phenyl oder Benzyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. J. Heterocycl. Chem. 9 (1972), 513-522).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Phenylisocyanate sind durch die Formel (VII), die alternativ zu verwendenden Phenylurethane durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In den allgemeinen Formeln (VII) und (VIII) haben Q, R^4 , R^5 und R^6 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt für Q, R^4 , R^5 und R^6 angegeben worden sind; R steht vorzugsweise für C_1 - C_4 -Alkyl, Phenyl oder Benzyl, insbesondere für Methyl, Ethyl, Phenyl oder Benzyl.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formeln (VII) und (VIII) sind noch nicht aus der Literatur bekannt; sie sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Man erhält die neuen substituierten Phenylisocyanate der allgemeinen Formel (VII), wenn man Anilinderivate der allgemeinen Formel (XI)



in welcher

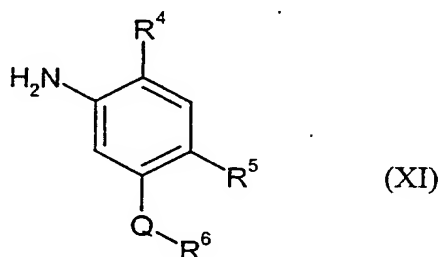
Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben,

5

mit Phosgen in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Chlorbenzol, bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C umgesetzt (vgl. auch EP-A-648749).

Man erhält die neuen substituierten Phenylurethane der allgemeinen Formel (VIII), wenn man Anilinderivate der allgemeinen Formel (XI)

10



in welcher

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben,

15

mit Chlorcarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (XII)



20 in welcher

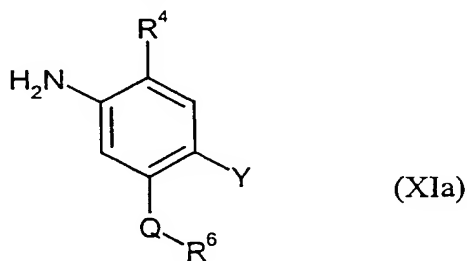
R die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Pyridin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Methylenchlorid, bei Temperaturen zwischen -20°C und $+100^{\circ}\text{C}$ umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

5

Die als Vorprodukte benötigten Anilinderivate der allgemeinen Formel (XI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE-A-3240975, DE-A-3337828, EP-A-79311).

10 Noch nicht bekannt und als neue Stoffe Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind die Anilinderivate der allgemeinen Formel (XIa)



in welcher

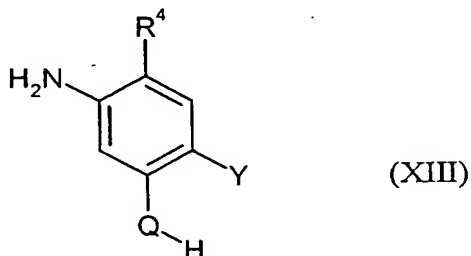
15 Q, R^4 und R^6 die oben angegebene Bedeutung haben und

Y für Cyano, Thiocarbamoyl oder Trifluormethyl steht.

Man erhält die neuen Anilinderivate der allgemeinen Formel (XIa), wenn man

20

(α) Aniline der allgemeinen Formel (XIII)



in welcher

Q, R⁴ und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

5 mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



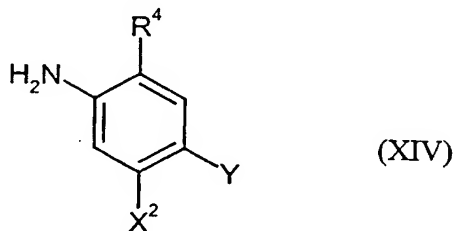
in welcher

10 R⁶ und X¹ die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumhydroxid, Kaliumcarbonat oder Pyridin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Methanol, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder N-Methylpyrrolidon, bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele),

oder wenn man

20 (β) Aniline der allgemeinen Formel (XIV)



in welcher

R⁴, X² und Y die oben angegebene Bedeutung haben,

25

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)



in welcher

M, Q und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben,

5

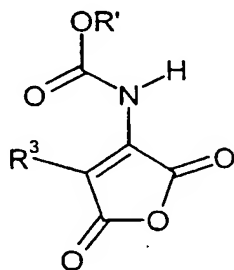
gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder N-Methyl-pyrrolidon, bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

10

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten N-Phenyl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (IX) haben Q, R⁴, R⁵ und R⁶ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder als am meisten bevorzugt für Q, R⁴, R⁵ und R⁶ angegeben worden sind; R⁴ steht vorzugsweise für C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

20

Man erhält die neuen substituierten N-Phenyl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide der allgemeinen Formel (IX), wenn man (2,5-Dioxo-2,5-dihydro-furan-3-yl)-carbamidsäure-alkylester der allgemeinen Formel (XV)



(XV)

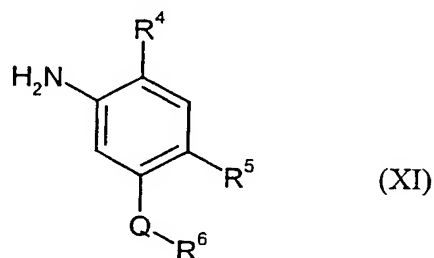
25

in welcher

R³ die oben angegebene Bedeutung hat und

R' für Alkyl (insbesondere Methyl oder Ethyl) steht,

mit Anilinderivaten der allgemeinen Formel (XI)



in welcher

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Essigsäure, bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C umgesetzt.

Die Vorprodukte der allgemeinen Formel (XV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE-A-19604229).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (e) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Phenyluracile sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (Ia) haben Q, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (Ia) für Verfahren (e) sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung; sie können nach den erfindungsgemäßen Verfahren (a) bis (d) hergestellt werden.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (e) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkylierungsmittel sind durch die Formel (X) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (X) steht A^1 vorzugsweise für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl; X^3 steht vorzugsweise für Chlor, Brom, Iod, Methoxysulfonyloxy oder Ethoxysulfonyloxy, insbesondere für Brom oder Methoxysulfonyloxy.

- 10 Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (X) sind bekannte organische Syntheschemikalien.

Die erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung von Verdünnungsmitteln durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c), (d) und (e) kommen neben Wasser vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Als Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (e) kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide
5 oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s-
10 oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-
15 pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8 Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

Als weitere Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c)
20 und (e) kommen auch Phasentransfer-Katalysatoren in Betracht. Als Beispiele für solche Katalysatoren seien genannt:

Tetrabutylammonium-bromid, Tetrabutylammonium-chlorid, Tetraoctylammonium-chlorid, Tetrabutylammonium-hydrogensulfat, Methyl-trioctylammonium-chlorid,
25 Hexadecyl-trimethylammonium-chlorid, Hexadecyl-trimethylammonium-bromid, Benzyl-trimethylammonium-chlorid, Benzyl-triethylammonium-chlorid, Benzyl-trimethylammonium-hydroxid, Benzyl-triethylammonium-hydroxid, Benzyl-tributylammonium-chlorid, Benzyl-tributylammonium-bromid, Tetrabutylphosphonium-bromid, Tetrabutylphosphonium-chlorid, Tributyl-hexadecylphosphonium-bromid,
30 Butyl-triphenylphosphonium-chlorid, Ethyl-trioctylphosphonium-bromid, Tetraphenylphosphonium-bromid.

Metallhydroxide, welche beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) eingesetzt werden, sind vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall-hydroxide, insbesondere Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid oder Calciumhydroxid.

5

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c), (d) und (e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

10

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c), (d) und (e) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

15

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

20

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

30

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsge-

mäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuss-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

5

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

15

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba- ren oder nicht schützba- ren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

20

25

30

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse

Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-
5 erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und
10 Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospho-
15 lipide, wie Kepheline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-
20 farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern („Safenem“) zur Unkrautbekämpfung verwendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es
30 sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxidim (-sodium),
Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine,
5 Azafenidin, Azimsulfuron, Bflubutamid, Benazolin (-ethyl), Benfuresate, Bensulf-
uron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop
(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim,
Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole,
Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben,
10 Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-
don (-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop (-
propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-methyl), Cloran-
sulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron,
Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Desmedipham, Diallate, Dicamba,
15 Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Diethatyl (-ethyl), Difenzoquat,
Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimetha-
metryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr,
Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron (-
methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop (-P-
20 ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl), Flazasulfuron,
Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone (-sodium), Flufenacet,
Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluo-
meturon, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpyr-
sulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl), Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypro-
25 pyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-methyl), Fluthiamide, Fome-
safen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammonium), Glyphosate (-isopropylammo-
nium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxyethyl, -P-methyl), Hexazinone, Imazametha-
benz (-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imaz-
ethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Iso-
30 proturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen,
Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metaza-

chlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-) Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron (-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Profluazol, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazone (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl), Pyriethionac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxymid, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tio- carbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tri- diphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insekti- ziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

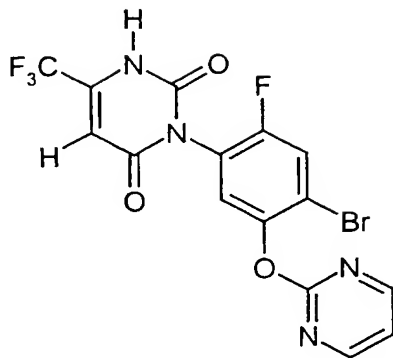
Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt wer- den. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden einge- arbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

5

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:**Beispiel 1**

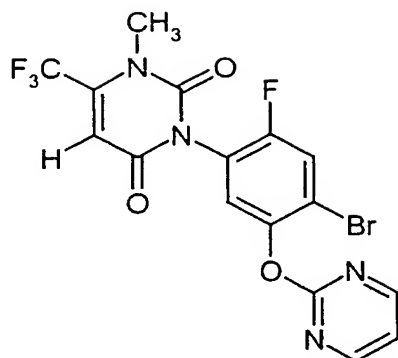
5 (Verfahren (c))

1,03 g (5,6 mMol) 3-Amino-4,4,4-trifluor-crotonsäure-methylester werden zu einer auf 0°C abgekühlten Mischung aus 0,28 g (7 mMol) Natriumhydrid (60%ige Disper-
sion in Mineralöl) in 10 ml N,N-Dimethyl-formamid gegeben. Man lässt die
10 Mischung unter Rühren auf Raumtemperatur (ca. 20°C) kommen und gibt dann eine
Lösung 2,0 g (5,62 Mol) N-[4-Brom-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl-oxy)-phenyl]-O-
ethyl-carbaminsäureester in 25 ml N,N-Dimethyl-formamid tropfenweise dazu. Die
Reaktionsmischung wird dann noch 6 Stunden auf 150°C erhitzt. Anschließend gießt
man die Mischung auf 300 ml 2N-Salzsäure, gibt etwa das gleiche Volumen einer
15 1:1-Mischung aus Diethylether und Petrolether dazu und rührt das Gemisch ca. 3
Stunden. Das hierbei kristallin anfallende Produkt wird durch Absaugen isoliert.

Man erhält 1,6 g (64% der Theorie) 1-[4-Brom-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl-oxy)-phe-
nyl]-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin.

20

$\log P = 1,96^a)$

Beispiel 2

(Verfahren (e))

- 5 0,46 g (3,6 mMol) Dimethylsulfat werden bei Raumtemperatur unter Rühren zu einer Mischung aus 1,35 g (3,0 mMol) 1-[4-Brom-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl-oxy)-phenyl]-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin, 0,84 g (6,0 mMol) Kaliumcarbonat und 25 ml Acetonitril tropfenweise gegeben und die Reaktionsmischung wird 2 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird
- 10 mit Wasser auf etwa das doppelte Volumen verdünnt und dann dreimal mit Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand in Essigsäureethylester aufgenommen und über Kieselgel abgesaugt. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand mit Diethylether digeriert und das hierbei kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.
- 15

Man erhält 0.70 g (51% der Theorie) 1-[4-Brom-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl-oxy)-phenyl]-3-methyl-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin.

$\log P = 2,47$ ^{a)}

20

Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

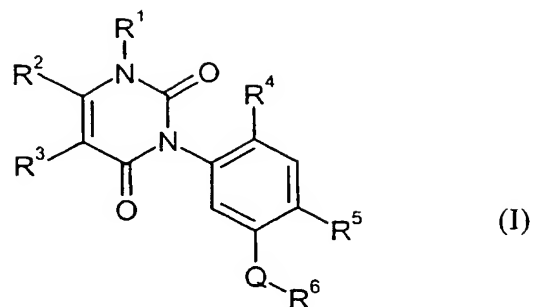
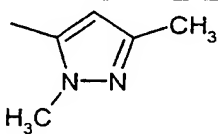
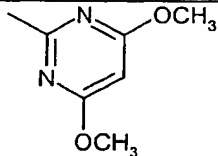
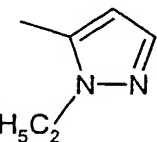
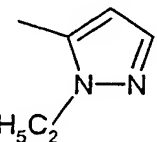
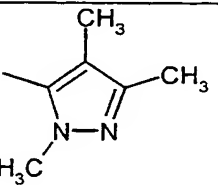
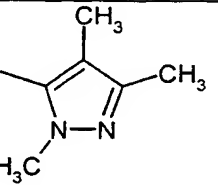
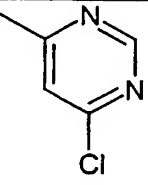
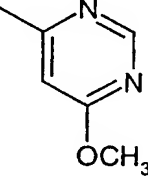
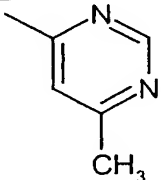
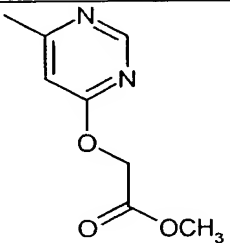
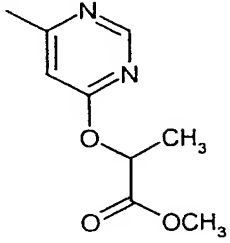
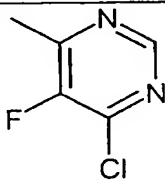

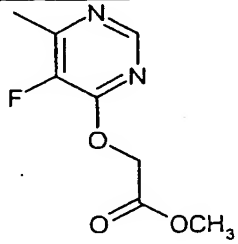
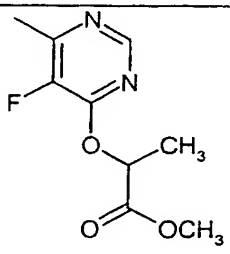
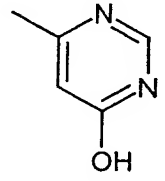
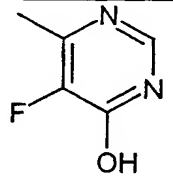
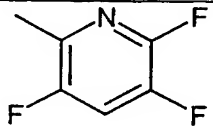
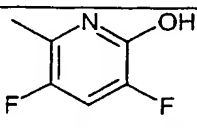
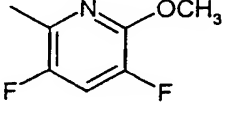
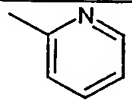
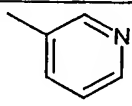
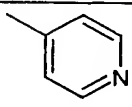


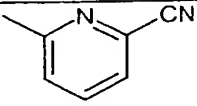
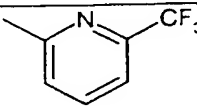
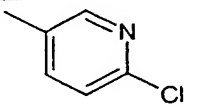
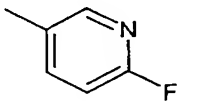
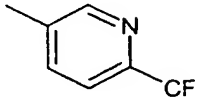
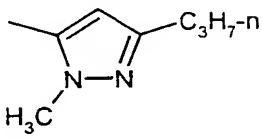
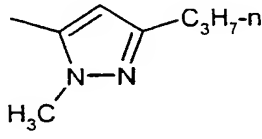
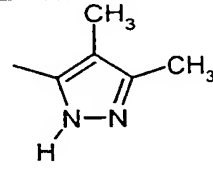
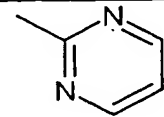
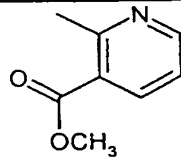
Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

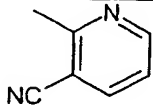
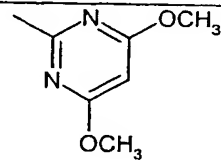
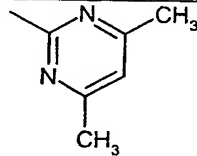
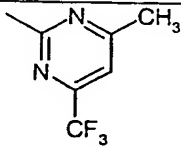
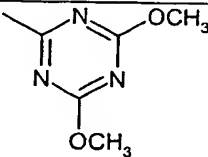
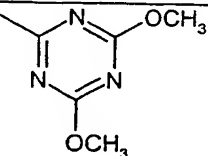
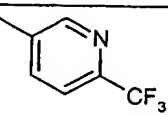
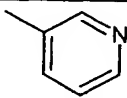
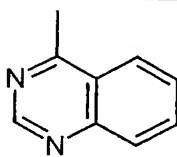
Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
3	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 96°C
4	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 186°C
5	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 143°C
6	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,59 ^{a)}
7	O	H	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,03 ^{a)}
8	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,50 ^{a)}

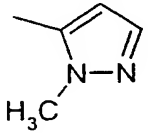
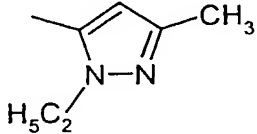
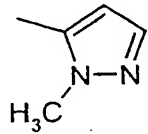
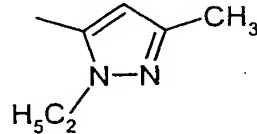
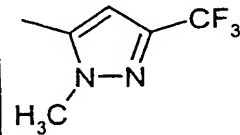
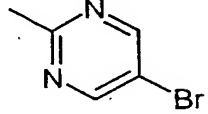
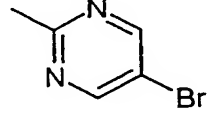
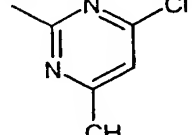

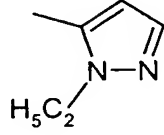
Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
9	O	NH ₂	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,21 ^{a)}
10	O	H	CF ₃	H	F	CN		
11	O	H	CF ₃	H	F	CN		
12	O	NH ₂	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,32 ^{a)}
13	O	H	CF ₃	H	F	CN		¹ H-NMR (CD ₃ CN, δ): 7,75 ppm
14	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 182°C
15	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 92°C
16	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		


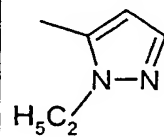

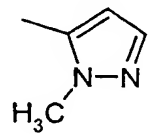
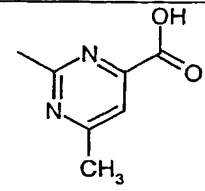
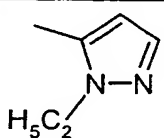
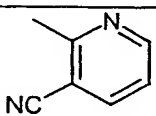
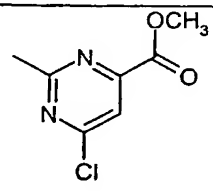
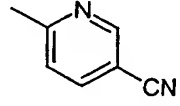
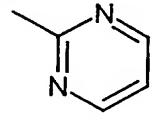
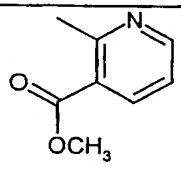
Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
17	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
18	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
19	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
20	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP=3,08 ^{a)}
21	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
22	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		

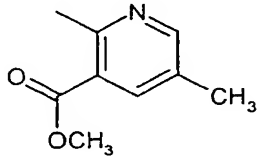
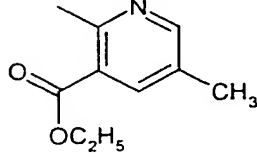
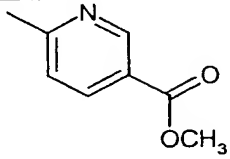
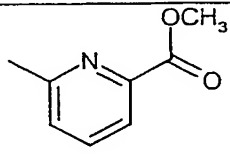
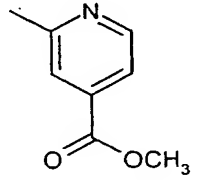
Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
23	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
24	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
25	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
26	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP=3,26 ^{a)}
27	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
28	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
29	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
30	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP=2,10 ^{a)}
31	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		

Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
32	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
33	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
34	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
35	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
36	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
37	O	H	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 172°C
38	O	NH ₂	CF ₃	H	F	CN		¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 6,39 ppm
39	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		Fp.: 260°C
40	O	NH ₂	CF ₃	H	F	Br		logP = 2,16 ^{a)}
41	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,70 ^{a)}

Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
42	O	H	CF ₃	H	F	Br		
43	O	H	CF ₃	H	F	Br		
44	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 2,84 ^{a)}
45	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 3,59 ^{a)}
46	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 2,93 ^{a)}
47	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 3,48 ^{a)}
48	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 3,83 ^{a)}
49	O	H	CF ₃	H	F	CN		
50	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,41 ^{a)}

Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
51	O	H	CF ₃	H	F	CN		logP = 1,88 ^{a)}
52	O	H	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,16 ^{a)}
53	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,33 ^{a)}
54	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 2,68 ^{a)}
55	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		logP = 3,26 ^{a)}
56	O	H	CF ₃	H	F	Br		
57	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 3,16 ^{a)}
58	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 3,20 ^{a)}
59	O	H		H	F	CN		

Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
60	O	CH ₃		H	F	CN		logP = 1,47 ^{a)}
61	O	H		H	F	CN		
62	O	H	CF ₃	H	F	Br		
63	O	CH ₃	CN	H	F	CN		logP = 2,11 ^{a)}
64	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 2,96 ^{a)}
65	O	CH ₃	CF ₃	H	F	Br		logP = 3,20 ^{a)}
66	O	H	CF ₃	H	F	Br		
67	O	NH ₂	CF ₃	H	F	CN		
68	O	CH ₃	CF ₃	H	H	CN		

Bsp.- Nr.	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
69	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
70	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
71	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
72	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		
73	O	CH ₃	CF ₃	H	F	CN		

Die Bestimmung der in Tabelle 1 angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1% wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit a) markiert.

10

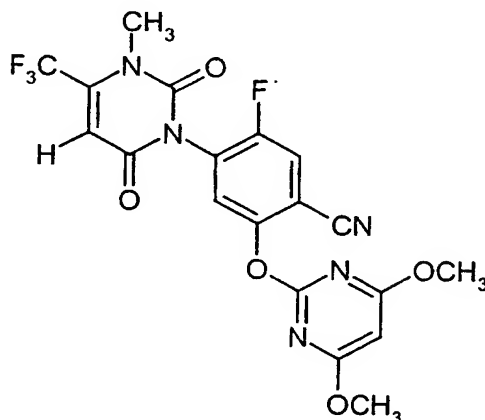
(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoff-
atomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der
Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden
Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in
den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

- Die oben in Tabelle 1 als Beispiel 4 aufgeführte Verbindung kann beispielsweise wie
folgt hergestellt werden:

Beispiel 4



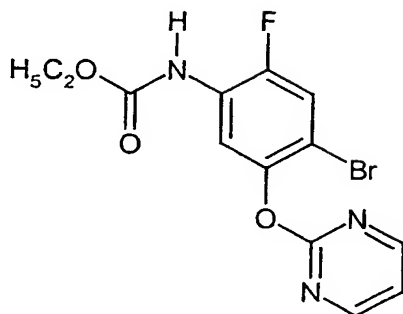
- (Verfahren (a))

Eine Mischung aus 0,50 g (1,5 mMol) 1-(4-Cyano-2-fluor-5-hydroxy-phenyl)-3-methyl-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin, 0,30 g (2,2 mMol) Kaliumcarbonat und 50 ml Dimethylsulfoxid wird 15 Minuten bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Nach Zugabe von 0,36 g (1,7 mMol) 4,6-Dimethoxy-2-methylsulfonyl-pyrimidin wird die Reaktionsmischung 3 Stunden bei 60°C, dann 8 Stunden bei 90°C, weitere 12 Stunden bei Raumtemperatur, weitere 12 Stunden bei 90°C und schließlich weitere 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wird auf eine gesättigte wässrige Lösung von Natriumchlorid gegossen, mit Essigsäureethylester ex-

trahiert, die organische Phase mit Wasser und dann mit gesättigter wässriger Lösung von Natriumchlorid gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand mit Diethylether / Diisopropylether digeriert und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

5

Man erhält 0,20 g (29% der Theorie) 1-[4-Cyano-2-fluor-5-(4,6-dimethoxy-pyrimidin-2-yl-oxy)-phenyl]-3-methyl-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin vom Schmelzpunkt 186°C.

Ausgangsstoffe der Formel (VIII):Beispiel (VIII-1)

- 5 2,0 g (7,0 mMol) 4-Brom-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl-oxy)-anilin werden in 25 ml Methylenchlorid vorgelegt und bei Raumtemperatur (ca. 20°C) mit 0,92 g (8,4 mMol) Chlorameisensäure-ethylester und dann mit 0,67 g (8,4 mMol) Pyridin versetzt. Die Reaktionsmischung wird dann 4 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird mit 2N-Salzsäure auf etwa das doppelte Volumen verdünnt und
- 10 mit Methylenchlorid extrahiert. Die organische Phase wird mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, der Rückstand mit Diethylether digeriert und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.
- 15 Man erhält 2,2 g (89% der Theorie) N-[4-Brom-2-fluor-5-(pyrimidin-2-yl-oxy)-phenyl]-O-ethyl-carbamidsäureester vom Schmelzpunkt 178°C.

20 Analog zu Beispiel (VIII-1) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (VIII) hergestellt werden.

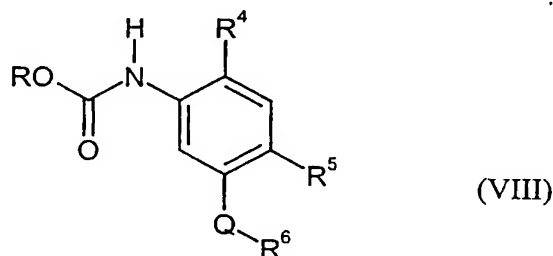
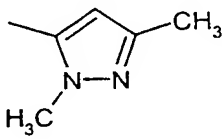
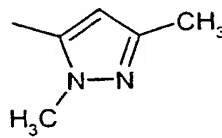
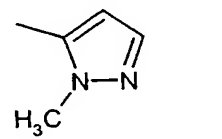
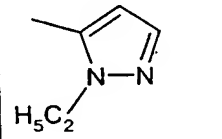
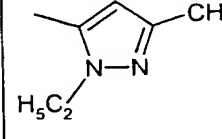
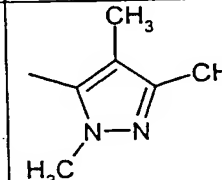
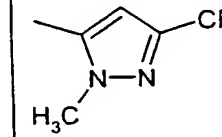
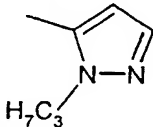
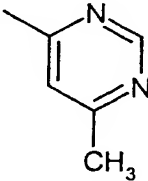
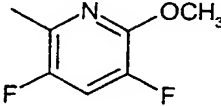
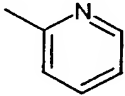
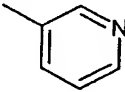
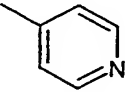
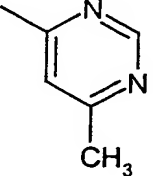
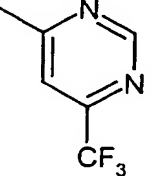


Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (VIII)

Bsp.- Nr.	Q	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R	Physikal. Daten
VIII-2	O	F	CN		C ₂ H ₅	logP = 2,19 ^{a)}
VIII-3	O	F	Br		C ₂ H ₅	
VIII-4	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-5	O	F	CN		C ₂ H ₅	Fp.: 158°C
VIII-6	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-7	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-8	O	F	CN		C ₂ H ₅	

Bsp.- Nr.	Q	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R	Physikal. Daten
VIII-9	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-10	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-11	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-12	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-13	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-14	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-15	O	F	CN		C ₂ H ₅	
VIII-16	O	F	CN		C ₂ H ₅	

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, dass die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

25

100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2 und 6 sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

Beispiel B

Post-emergence-Test

- 5 Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

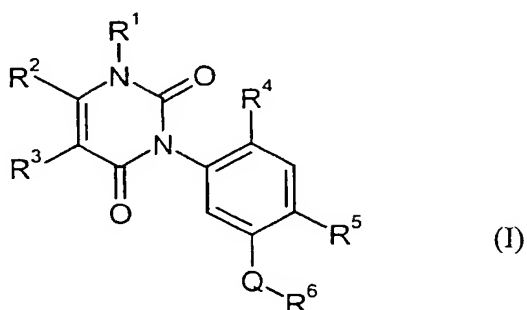
0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

25 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2 und 6 sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I)



5

in welcher

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO₂ steht,

10

R¹ für Wasserstoff, Amino, gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

15

R² für Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

20

R³ für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

R⁴ für Wasserstoff, Nitro, Cyano oder Halogen steht,

R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, und

5 R⁶ für eine gegebenenfalls durch Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Cyano-C₁-C₄-alkyl, Carboxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylamino-carbonylalkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylalkyl, C₁-C₄-Alkoxy,
10 Cyano-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, Carboxy-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
15 C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl-amino, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-amino oder C₁-C₄-Alkyl-sulfonyl-amino substituierte stickstoffhaltige heterocyclische Gruppierung aus der Reihe Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Triazoliny, Pyridinyl,
20 Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Chinolinyl, Chinazolinyl, Chinoxalinyl steht,

- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze bzw. Säure- oder
25 Basen-Addukte der Verbindungen der allgemeinen Formel (I).

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel) oder SO₂ steht,

- 5
10
15
20
25
30
- R^1 für Wasserstoff, Amino, jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl steht,
- R^2 für Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,
- R^3 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,
- R^4 für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor oder Brom steht,
- R^5 für Cyano, Thiocarbamoyl, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht, und
- R^6 für eine jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Chlormethyl, Fluormethyl, Dichlormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Chlorethyl, Fluorethyl, Dichlorethyl, Difluorethyl, Chlorfluorethyl, Trichlorethyl, Trifluorethyl, Chlordifluorethyl, Fluordichlorethyl, Tetrafluorethyl, Chlortrifluorethyl, Pentafluorethyl, Chlor-n-propyl, Fluor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Fluor-i-propyl, Dichlorpropyl, Difluorpropyl, Trichlorpropyl, Trifluorpropyl, Cyanomethyl, Cyanoethyl, Cyanopropyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxy-

5 methyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, n- oder i-Propoxycarbonylmethyl, Methylaminocarbonylmethyl, Ethylaminocarbonylmethyl, Dimethylaminocarbonylmethyl, Methoxycarbonylethyl, Ethoxycarbonylethyl, n- oder i-Propoxycarbonylethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Carboxymethoxy, Carboxyethoxy, Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylmethoxy, Methylaminocarbonylmethoxy, Ethylaminocarbonylmethoxy, Dimethylaminocarbonylmethoxy, Methoxycarbonylethoxy, Ethoxycarbonylethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylethoxy, Methylaminocarbonylethoxy, Ethylaminocarbonylethoxy, Dimethylaminocarbonylethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Acetyl-amino, Propionyl-amino, n- oder i-Butyroyl-amino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino substituierte stickstoffhaltige heterocyclische Gruppierung aus der Reihe Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Triazoliny, Pyridinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Chinoliny, Chinazoliny, Chinoxaliny steht.

3. Verbindungen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass

Q für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

- R¹ für Wasserstoff, Amino oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl steht,
- 5 R² für Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl steht,
- 10 R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,
- R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
- 15 R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Brom oder Trifluormethyl steht, und
- 20 R⁶ für eine jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Dichlormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluor-
methoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Carboxymethoxy, Carboxyethoxy, Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylmethoxy, Methoxycarbonylethoxy, Ethoxy-
carbonylethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy,
25 Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Trifluor-
methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Acetyl-amino, Propionyl-amino, n- oder i-
30 Butyroyl-amino, Methoxycarbonyl-amino, Ethoxycarbonyl-amino, n- oder i-Propoxycarbonyl-amino, Methylsulfonyl-amino, Ethylsulfonyl-

amino, n- oder i-Propylsulfonylamino substituierte stickstoffhaltige heterocyclische Gruppierung aus der Reihe Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Triazoliny, Pyridiny, Pyraziny, Pyridaziny, Pyrimidiny, Triaziny, Benzoxazolyl, Benzthiazolyl, Chinoliny, Chinazoliny, Chinoxaliny steht.

4. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass

R^1 für Wasserstoff, Amino, Methyl oder Ethyl steht,

R^2 für Cyano oder Trifluormethyl steht,

R^3 für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

R^5 für Cyano, Thiocarbamoyl oder Brom steht, und

R^6 für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Dichlormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Carboxymethoxy, Carboxyethoxy, Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylmethoxy, Methoxycarbonylethoxy, Ethoxycarbonylethoxy, n- oder i-Propoxycarbonylethoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy, Butinyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Propionyl-

amino, n- oder i-Butyroylamino, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino substituiertes Pyrazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl oder Benzoxazolyl steht.

5

5. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass

R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,

10

R² für Trifluormethyl steht,

R⁵ für Cyano oder Brom steht, und

15

R⁶ für jeweils gegebenenfalls durch Hydroxy, Amino, Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trichlormethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Pyrazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl oder Benzoxazolyl steht.

20

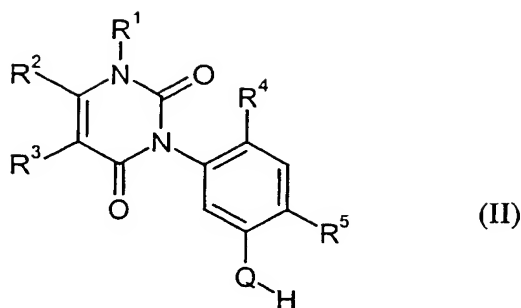
6. Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass

Q für O (Sauerstoff) steht.

25

7. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, dass man

(a) Phenyluracile der allgemeinen Formel (II)



(II)

in welcher

Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

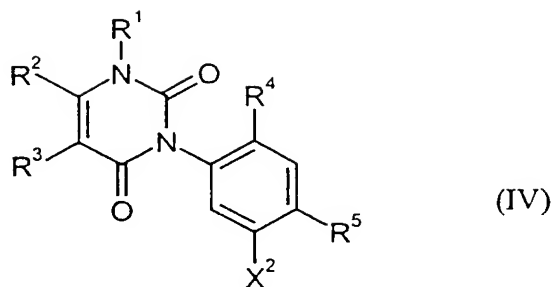
R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebene Bedeutung hat und

X¹ für Halogen oder Alkylsulfonyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittel umsetzt,

oder dass man

(b) Halogenphenyluracile der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebene Bedeutung haben, und

X² für Halogen steht,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)



in welcher

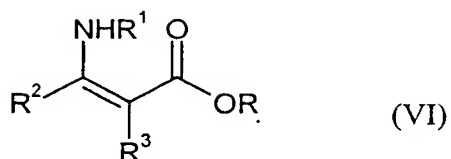
Q und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben und

M für Wasserstoff oder ein Metalläquivalent steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittel umgesetzt,

oder dass man

(c) Aminoalkensäureester der allgemeinen Formel (VI)

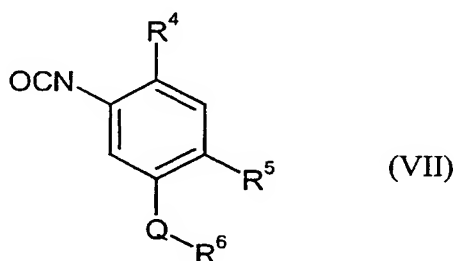


in welcher

R¹, R² und R³ die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebene Bedeutung
haben und

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

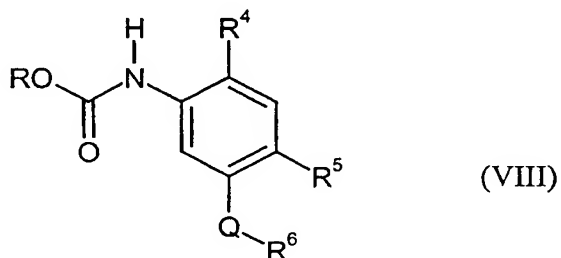
mit substituierten Phenylisocyanaten der allgemeinen Formel (VII)



in welcher

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung
haben,

oder mit substituierten Phenylurethanen (Phenylcarbamat) der allgemeinen
Formel (VIII)



in welcher

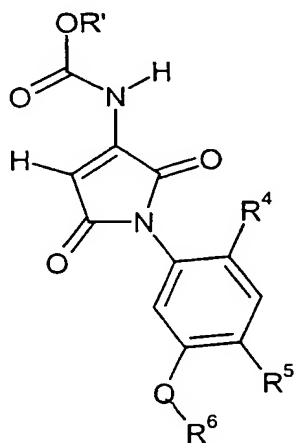
Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben und

5 R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

10 oder dass man

(d) substituierte N-Phenyl-1-alkoxycarbonylamino-maleinimide der allgemeinen Formel (IX)



15 in welcher

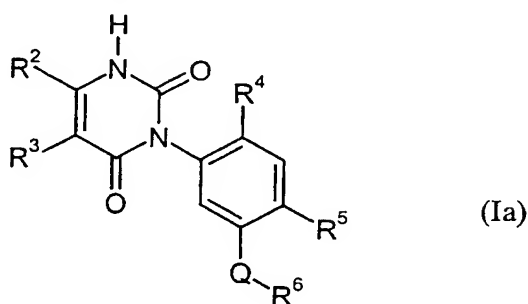
Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben und

20 R' für Alkyl steht,

mit einem Metallhydroxid in Gegenwart von Wasser und gegebenenfalls in Gegenwart eines organischen Lösungsmittels umgesetzt,

oder dass man

(e) substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (Ia)



5

in welcher

Q, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

10

mit 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol oder 2-Aminooxysulfonyl-1,3,5-trimethylbenzol bzw. mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (X)



15

in welcher

A¹ für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, und

20

X³ für Halogen oder die Gruppierung -O-SO₂-O-A¹ steht,

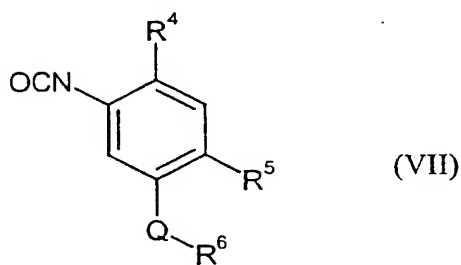
25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittel umgesetzt,

und gegebenenfalls im Anschluss daran im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt.

5

8. Verbindungen der Formel (VII)



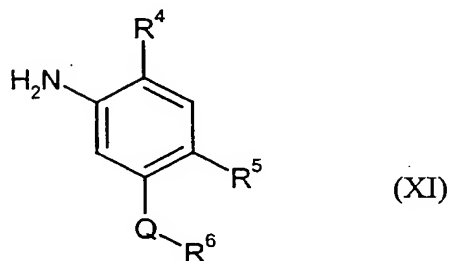
in welcher

10

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben.

9. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, dass man Anilinderivate der allgemeinen Formel (XI)

15



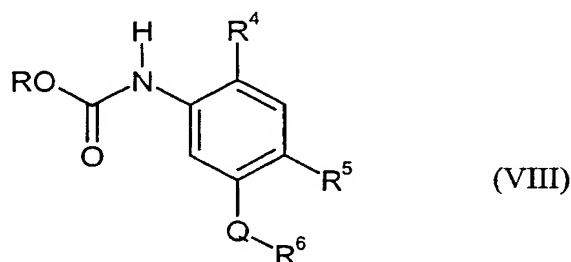
in welcher

20

Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

mit Phosgen in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Chlorbenzol, bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C umsetzt.

- 5 10. Verbindungen der Formel (VIII)

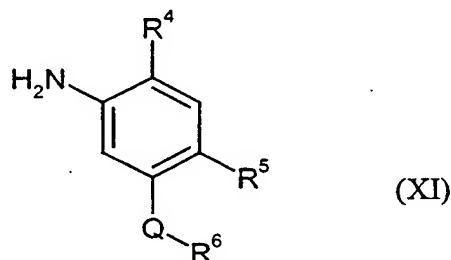


in welcher

- 10 Q, R⁴, R⁵, R⁶ und R die in einem der Ansprüche 1 bis 7 angegebenen Bedeutungen haben.

11. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß Anspruch 10, dadurch gekennzeichnet, dass man Anilinderivate der allgemeinen Formel (XI)

15



in welcher

- 20 Q, R⁴, R⁵ und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

mit Chlorcarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (XII)



in welcher

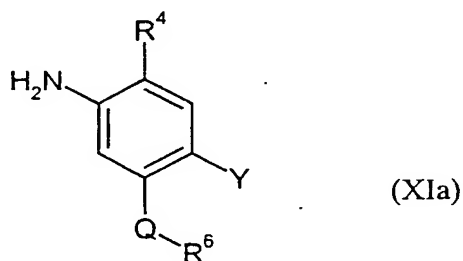
5

R für Alkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Pyridin, und gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Methylenchlorid, bei Temperaturen zwischen -20°C und $+100^{\circ}\text{C}$ umgesetzt.

10

12. Verbindungen der Formel (XIa)



15

in welcher

Q, R^4 und R^6 die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben und

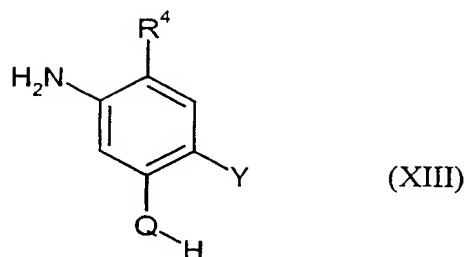
20

Y für Cyano, Thiocarbamoyl oder Trifluormethyl steht.

13. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet, dass man

25

(α) Aniline der allgemeinen Formel (XIII)



in welcher

Q, R⁴ und Y die in einem der Ansprüche 1 bis 6 und 12 angegebene Bedeutung haben,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



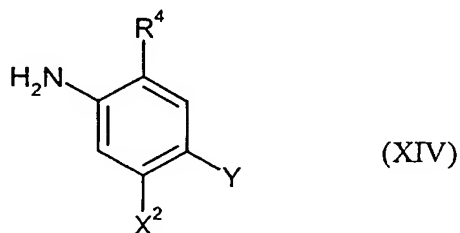
in welcher

R⁶ und X¹ die in einem der Ansprüche 1 bis 5 und 7 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, wie z.B. Kaliumhydroxid, Kaliumcarbonat oder Pyridin, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C umgesetzt,

oder dass man

(β) Aniline der allgemeinen Formel (XIV)



in welcher

R^4 , X^2 und Y die in einem der Ansprüche 1 bis 5, 7 und 12 angegebene Bedeutung haben,

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (V)

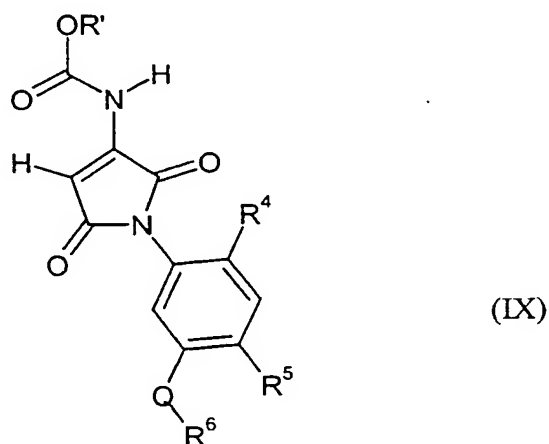


in welcher

M, Q und R^6 die in einem der Ansprüche 1 bis 7 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C umgesetzt.

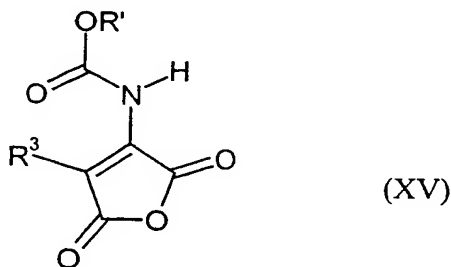
14. Verbindungen der Formel (IX)



in welcher

Q, R^4 , R^5 und R^6 die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben und R' für Alkyl steht.

15. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß Anspruch 14, dadurch gekennzeichnet, dass man (2,5-Dioxo-2,5-dihydro-furan-3-yl)-carbamidsäure-alkylester der allgemeinen Formel (XV)

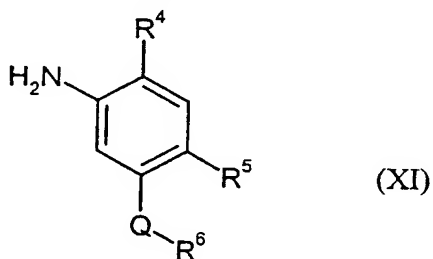


in welcher

R^3 die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebene Bedeutung hat und

R^4 für Alkyl steht,

mit Anilinderivaten der allgemeinen Formel (XI)

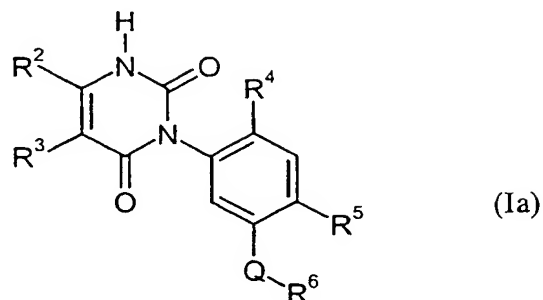


in welcher

Q , R^4 , R^5 und R^6 die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C umsetzt.

16. Verbindungen der Formel (Ia)



in welcher

5

Q , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^6 die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben.

17. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 und üblichen Streckmitteln.

10

18. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 oder eines Mittels gemäß Anspruch 17 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.

15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Patent Application No

PCT/EP 01/03332

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D239/54 C07D403/12 C07D401/12 C07D239/34 A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	W0 98 41093 A (ISHIHARA) 24 September 1998 (1998-09-24) cited in the application page 1 -page 24; claims; tables 1-11 ---	1-3,6-18
X	EP 0 255 047 A (HOFFMAN LA ROCHE) 3 February 1988 (1988-02-03) page 29, line 18 -page 31, line 6; claims ---	1,6,7, 17,18
A	W0 99 21837 A (ISK AMERICAS) 6 May 1999 (1999-05-06) claims; examples 1.23,2.199; tables I,II ---	1-3,6-18
A	W0 00 02866 A (BAYER) 20 January 2000 (2000-01-20) the whole document ---	1-3,6-18
	--- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 August 2001

Date of mailing of the international search report

10/08/2001

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Francois, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information Publication No

PCT/EP 01/03332

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DE 32 40 975 A (CIBA-GEIGY) 19 May 1983 (1983-05-19) claim 11; figures II, IV -----	12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/03332

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9841093	A	24-09-1998	AU 5816198 A BR 9808334 A CN 1255042 T EP 0973395 A HR 980135 A PL 335697 A TR 9902243 T ZA 9802158 A	12-10-1998 16-05-2000 31-05-2000 26-01-2000 28-02-1999 08-05-2000 21-12-1999 14-09-1998
EP 255047	A	03-02-1988	AU 604250 B AU 7637187 A CA 1286662 A CN 87105777 A DK 366887 A HU 44902 A US 4859229 A BR 8703926 A JP 63041466 A ZA 8705466 A	13-12-1990 11-02-1988 23-07-1991 06-04-1988 13-05-1988 30-05-1988 22-08-1989 05-04-1988 22-02-1988 02-02-1988
WO 9921837	A	06-05-1999	AU 9565098 A CN 1283190 T EP 1030843 A HU 0004151 A ZA 9809639 A	17-05-1999 07-02-2001 30-08-2000 28-02-2001 26-04-1999
WO 0002866	A	20-01-2000	DE 19853864 A AU 5029999 A BR 9911978 A EP 1095027 A	13-01-2000 01-02-2000 27-03-2001 02-05-2001
DE 3240975	A	19-05-1983	NONE	

INTERNATIONALE RESEARCHENBERICHT

Internationale Patentzeichen

PCT/EP 01/03332

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D239/54 C07D403/12 C07D401/12 C07D239/34 A01N43/54

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 41093 A (ISHIHARA) 24. September 1998 (1998-09-24) in der Anmeldung erwähnt Seite 1 -Seite 24; Ansprüche; Tabellen 1-11 ---	1-3,6-18
X	EP 0 255 047 A (HOFFMAN LA ROCHE) 3. Februar 1988 (1988-02-03) Seite 29, Zeile 18 -Seite 31, Zeile 6; Ansprüche ---	1,6,7, 17,18
A	WO 99 21837 A (ISK AMERICAS) 6. Mai 1999 (1999-05-06) Ansprüche; Beispiele 1.23,2.199; Tabellen I,II --- -/--	1-3,6-18



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

2. August 2001

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

10/08/2001

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Belr. Anspruch Nr.
A	WO 00 02866 A (BAYER) 20. Januar 2000 (2000-01-20) das ganze Dokument ----	1-3,6-18
A	DE 32 40 975 A (CIBA-GEIGY) 19. Mai 1983 (1983-05-19) Anspruch 11; Abbildungen II,IV -----	12

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die der selben Patentfamilie gehören

Internationale Anzeichen

PCT/EP 01/03332

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9841093 A	24-09-1998	AU 5816198 A	12-10-1998
		BR 9808334 A	16-05-2000
		CN 1255042 T	31-05-2000
		EP 0973395 A	26-01-2000
		HR 980135 A	28-02-1999
		PL 335697 A	08-05-2000
		TR 9902243 T	21-12-1999
		ZA 9802158 A	14-09-1998
EP 255047 A	03-02-1988	AU 604250 B	13-12-1990
		AU 7637187 A	11-02-1988
		CA 1286662 A	23-07-1991
		CN 87105777 A	06-04-1988
		DK 366887 A	13-05-1988
		HU 44902 A	30-05-1988
		US 4859229 A	22-08-1989
		BR 8703926 A	05-04-1988
		JP 63041466 A	22-02-1988
		ZA 8705466 A	02-02-1988
WO 9921837 A	06-05-1999	AU 9565098 A	17-05-1999
		CN 1283190 T	07-02-2001
		EP 1030843 A	30-08-2000
		HU 0004151 A	28-02-2001
		ZA 9809639 A	26-04-1999
WO 0002866 A	20-01-2000	DE 19853864 A	13-01-2000
		AU 5029999 A	01-02-2000
		BR 9911978 A	27-03-2001
		EP 1095027 A	02-05-2001
DE 3240975 A	19-05-1983	KEINE	

THIS PAGE BLANK (USPTO)

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)